

BERICHTIGTE FASSUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
29. Juni 2000 (29.06.2000)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 00/37487 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07K 7/06, 7/08,  
C12N 15/10, A61K 38/04, A61P 7/02

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/09842

(22) Internationales Anmeldedatum:  
11. Dezember 1999 (11.12.1999)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
198 58 857.7 19. Dezember 1998 (19.12.1998) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter  
Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DIEFENBACH, Beate  
[DE/DE]; Friedrich-Ebert-Platz 19, D-64289 Darmstadt  
(DE). JONCZYK, Alfred [DE/DE]; Schepp-Allee 57,  
D-64295 Darmstadt (DE). KRAFT, Sabine [DE/DE];  
Giselherstrasse 8, D-65668 Rimbach (DE). MEHTA,  
Ray [IN/GB]; MRC Collaborative Centre, 1-3 Bustanhole  
Lane, Mill London NW7 1AD (GB).

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH;  
Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN,  
IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,  
MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US,  
UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasis-  
ches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI,  
FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— Mit internationalem Recherchenbericht.

(48) Datum der Veröffentlichung dieser berichtigten  
Fassung: 29. März 2001

(15) Informationen zur Berichtigung:  
siehe PCT Gazette Nr. 13/2001 vom 29. März 2001, Sec-  
tion II

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title:  $\alpha_v\beta_6$  INTEGRIN INHIBITORS

(54) Bezeichnung: INHIBITOREN DES INTEGRINS  $\alpha_v\beta_6$

(57) Abstract: The invention relates to novel peptides which are biologically active as ligands of  $\alpha_v\beta_6$  integrin. Said peptides have a common structural motif, i.e. Asp Leu Xaa Leu - or in a preferred form Arg Xaa Asp Leu Xaa Xaa Leu Arg-, wherein Xaa represents any amino acid radical. The peptides according to the invention can be used as efficient  $\alpha_v\beta_6$  integrin receptor inhibitors and consequently in the treatment of different diseases and pathologies.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung beschreibt neuartige Peptide, welche als Liganden des Integrins  $\alpha_v\beta_6$  biologisch wirksam sind. Diese Peptide weisen alle ein gemeinsames Strukturmotiv, nämlich - Asp Leu Xaa Leu -, bzw. in einer bevorzugten Form - Arg Xaa Asp Leu Xaa Xaa Leu Arg - auf, wobei Xaa für einen beliebigen Aminosäurerest steht. Die erfindungsgemäßen Peptide können als wirksame Inhibitoren des  $\alpha_v\beta_6$ -Integrin-Rezeptors und somit zur Behandlung verschiedener Krankheiten und pathologischer Befunde eingesetzt werden.

WO 00/37487 A1